

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005年2月3日 (03.02.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/009991 A1

(51) 国際特許分類7: C07D 401/14, 401/04, A61K 31/444, 31/4439, A61P 19/06

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/010456

(22) 国際出願日: 2004年7月23日 (23.07.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2003-201286 2003年7月24日 (24.07.2003) JP

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 株式会社富士薬品 (FUJIYAKUHIN CO., LTD.) [JP/JP]; 〒3300854 埼玉県さいたま市大宮区桜木町4丁目383番地 Saitama (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 中村 洋 (NAKAMURA, Hiroshi) [JP/JP]; 〒3310047 埼玉県さいたま市

西区指扇3936番地2 株式会社富士薬品第一研究所内 Saitama (JP). 雨田淳一郎 (UDA, Junichiro) [JP/JP]; 〒3310047 埼玉県さいたま市西区指扇3936番地2 株式会社富士薬品第一研究所内 Saitama (JP). 大野敦嗣 (ONO, Atsushi) [JP/JP]; 〒3310047 埼玉県さいたま市西区指扇3936番地2 株式会社富士薬品第一研究所内 Saitama (JP). 佐藤隆弘 (SATO, Takahiro) [JP/JP]; 〒3310047 埼玉県さいたま市西区指扇3936番地2 株式会社富士薬品第一研究所内 Saitama (JP).

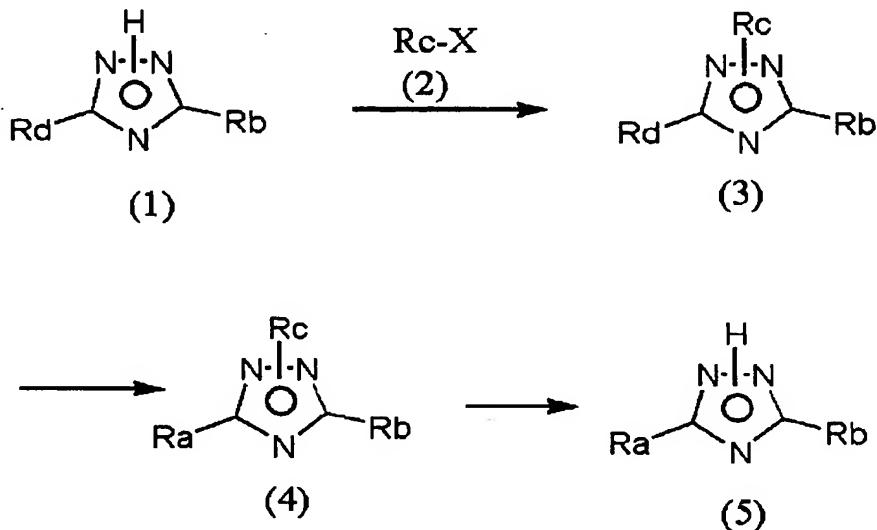
(74) 代理人: 特許業務法人アルガ特許事務所 (THE PATENT CORPORATE BODY ARUGA PATENT OFFICE); 〒1030013 東京都中央区日本橋人形町1丁目3番6号共同ビル Tokyo (JP).

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,

[統葉有]

(54) Title: PROCESS FOR PRODUCING 1,2,4-TRIAZOLE COMPOUND AND INTERMEDIATE THEREFOR

(54) 発明の名称: 1, 2, 4-トリアゾール化合物の製造方法及びその中間体



(57) Abstract: A process for producing a 1,2,4-triazole compound (5) or a salt or hydrate thereof which comprises reacting a compound (1) with  $Rc-X$  (2) to yield a compound (3), reacting the compound (3) with a nitrile-forming agent to yield a compound (4), and then removing the group  $Rc$ , as shown in the following reaction scheme: [Chemical formula 1] (wherein  $Ra$ ,  $Rb$ , and  $Rd$  each represents a substituent; and  $Rc$  represents a group removable by an acid). The compound (5), which has an optionally substituted 2-cyanopyridin-4-yl group in the 3-position and an optionally substituted aromatic group in the 5-position, can be produced from the compound (1) in high yield without necessitating the isolation of any reaction product during the reactions. The compound (5) inhibits xanthine oxidase and is useful in treatments for gout and hyperuricemia.

[統葉有]

WO 2005/009991 A1



LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ヨーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,

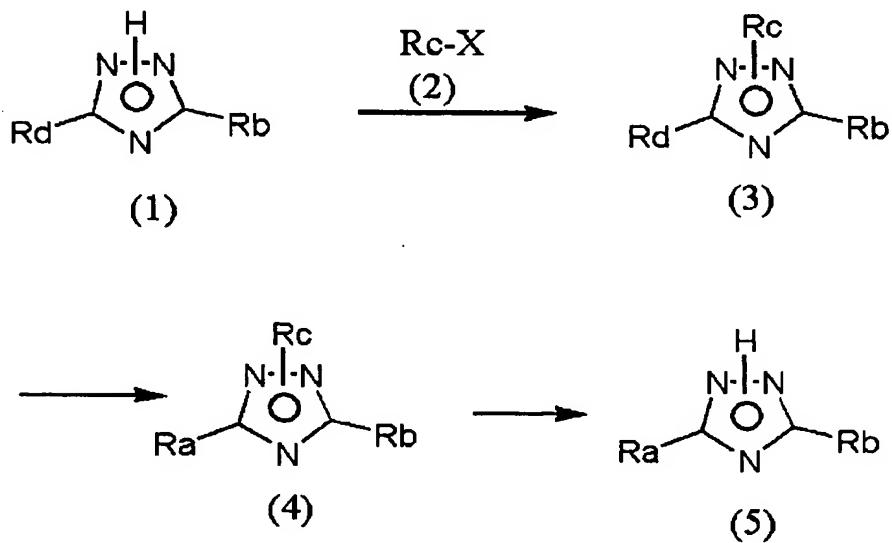
添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイドスノート」を参照。

(57) 要約:

次の反応式

【化1】



(式中、Ra、Rb及びRdは置換基、Rcは酸によって除去できる基を示す)に示すように、化合物(1)にRc-X(2)を反応させて化合物(3)を得、これにニトリル化剤を反応させ化合物(4)を得、次いで基Rcを除去する1, 2, 4-トリアゾール化合物(5)、その塩又は水和物の製造方法。化合物(1)より、反応途中で反応生成物をいずれも単離することなく高収率で、キサンチンオキシダーゼを阻害し、痛風、高尿酸血症の治療に有用である置換基を有していてよい2-シアノピリジン-4-イル基を3位に有し、かつ置換基を有していてよい芳香族基を5位に有する1, 2, 4-トリアゾール化合物(5)を製造することができる。